

10/501677

Rec'd PCT PTO 16 JUL 2004

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
24. Juli 2003 (24.07.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2003/059323 A3**(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 9/16,  
9/00, 9/20, C07C 229/26MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/000059

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).(22) Internationales Anmeldedatum:  
7. Januar 2003 (07.01.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

**Erklärung gemäß Regel 4.17:**

— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)*

(30) Angaben zur Priorität:  
102 02 019.1 18. Januar 2002 (18.01.2002) DE**Veröffentlicht:**— *mit internationalem Recherchenbericht*(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 11. März 2004(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): ECKER, Felix [DE/US]; 72 Grove Avenue, Morris Plains, NJ 07950 (US). BÜLLESBACH, Ralf [DE/US]; 6 Yorkshire Drive, Hackettstown, NJ 07840 (US). LEDWOCH, Wolfram [DE/DE]; Zum Stadion 17, 40764 Langenfeld (DE). FRANCKOWIAK, Gerhard [DE/DE]; Henselweg 10, 42115 Wuppertal (DE). GEßNER, Uwe [DE/DE]; Brücker Wiese 12, 53819 Neunkirchen-Seelscheid (DE). PETERSEN-BRAUN, Marianne [DE/DE]; Zur Mühle 13, 53639 Königswinter (DE).

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG;  
51368 Leverkusen (DE).(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,

A3

(54) Title: STABLE SALTS OF O-ACETYLSALICYLIC ACID CONTAINING BASIC AMINO ACIDS II

(54) Bezeichnung: STABILE SALZE VON O-ACETYLSALICYLSÄURE MIT BASISCHEN AMINOSÄUREN II

(57) Abstract: The invention relates to improved compositions comprising stable salts of o-acetylsalicylic acid containing basic amino acids. The invention also relates to pharmaceuticals containing said compositions and to the use of the same for producing pharmaceuticals.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft verbesserte Zusammensetzungen mit stabilen Salzen von o-Acetylsalicylsäure mit basischen Aminosäuren, diese enthaltende Arzneimittel sowie deren Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln.

BEST AVAILABLE COPY

BEST AVAILABLE COPY

WO 2003/059323 A3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/00059

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A61K9/16 A61K9/00 A61K9/20 C07C229/26

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 02 05782 A (FRANCKOWIAK GERHARD ;WIRGES HANS PETER (DE); APPOLT HUBERT (DE); B) 24 January 2002 (2002-01-24) cited in the application page 1, line 1 - line 11 page 2, line 21 -page 3, line 17 page 10, line 14 - line 18 claims; examples ---	1,4-8, 10-14
Y	US 4 988 683 A (CORBIERE JEROME) 29 January 1991 (1991-01-29) column 1, line 26 - line 38 column 2, line 40 - line 47 claims; examples ---	1-14 -/-

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the International filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the Invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed Invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed Invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

28 May 2003

Date of mailing of the International search report

04/07/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax. (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Rankin, R

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 83/00059

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 4 265 888 A (KAGITANI YOSHIO ET AL) 5 May 1981 (1981-05-05) column 1, line 1 - line 25 column 2, line 5 - line 18 column 3, line 20 - line 28	1-14

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**International application No.  
PCT/EP 03/00059**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: 14 because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

**See supplemental sheet. Further information PCT/ISA/210**

2.  Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3.  Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

**Continuation of I.1**

Although Claim 14 relates to a method for treatment of the human body, the search was carried out on the basis of the alleged effects of the composition.

-----

**Continuation of I.1**

**Claim: 14**

PCT Rule 39.1(iv) – method for treatment of the human or animal body by therapy.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP03/00059

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 0205782	A	24-01-2002	DE AU CZ WO NO US	10034802 A1 7847101 A 20030164 A3 0205782 A2 20030222 A 2002091108 A1	31-01-2002 30-01-2002 16-04-2003 24-01-2002 16-01-2003 11-07-2002
US 4988683	A	29-01-1991	FR EP WO ZA	2611501 A1 0305464 A1 8806449 A1 8801571 A	09-09-1988 08-03-1989 07-09-1988 29-08-1988
US 4265888	A	05-05-1981	JP JP JP CH DE FR GB HK	1354019 C 56010110 A 61021528 B 642261 A5 3000743 A1 2460672 A1 2051573 A ,B 66785 A	24-12-1986 02-02-1981 27-05-1986 13-04-1984 08-01-1981 30-01-1981 21-01-1981 13-09-1985

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 03/00059

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
**IPK 7 A61K9/16 A61K9/00 A61K9/20 C07C229/26**

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBiete**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

**IPK 7 A61K C07C**

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

**EPO-Internal, CHEM ABS Data, PAJ, WPI Data**

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	WO 02 05782 A (FRANCKOWIAK GERHARD ; WIRGES HANS PETER (DE); APPOLT HUBERT (DE); B) 24. Januar 2002 (2002-01-24) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 1 - Zeile 11 Seite 2, Zeile 21 - Seite 3, Zeile 17 Seite 10, Zeile 14 - Zeile 18 Ansprüche; Beispiele ---	1, 4-8, 10-14
Y	US 4 988 683 A (CORBIERE JEROME) 29. Januar 1991 (1991-01-29) Spalte 1, Zeile 26 - Zeile 38 Spalte 2, Zeile 40 - Zeile 47 Ansprüche; Beispiele ---	1-14 -/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts
28. Mai 2003	04/07/2003
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Rankin, R

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationaler Aktenzeichen

PCT/EP/03/00059

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	US 4 265 888 A (KAGITANI YOSHIO ET AL) 5. Mai 1981 (1981-05-05) Spalte 1, Zeile 1 - Zeile 25 Spalte 2, Zeile 5 - Zeile 18 Spalte 3, Zeile 20 - Zeile 28 -----	1-14

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 03/00059

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr. 14  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich  
**siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210**
2.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der Internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle Internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3.  Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese Internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der Internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN	PCT/ISA/ 210
<p>Fortsetzung von Feld I.1</p> <p>Obwohl die Ansprüche 14 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Zusammensetzung.</p> <hr/> <p>Fortsetzung von Feld I.1</p> <p>Ansprüche Nr.: 14</p> <p>Regel 39.1(iv) PCT – Verfahren zur therapeutischen Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers</p>	

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur **Patentfamilie** gehören

Internat. Aktenzeichen

PCT/EP 03/00059

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 0205782	A	24-01-2002	DE AU CZ WO NO US	10034802 A1 7847101 A 20030164 A3 0205782 A2 20030222 A 2002091108 A1	31-01-2002 30-01-2002 16-04-2003 24-01-2002 16-01-2003 11-07-2002
US 4988683	A	29-01-1991	FR EP WO ZA	2611501 A1 0305464 A1 8806449 A1 8801571 A	09-09-1988 08-03-1989 07-09-1988 29-08-1988
US 4265888	A	05-05-1981	JP JP JP CH DE FR GB HK	1354019 C 56010110 A 61021528 B 642261 A5 3000743 A1 2460672 A1 2051573 A ,B 66785 A	24-12-1986 02-02-1981 27-05-1986 13-04-1984 08-01-1981 30-01-1981 21-01-1981 13-09-1985

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**